

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
29. Januar 2004 (29.01.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2004/009125 A2

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 47/48

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/007892

(22) Internationales Anmeldedatum:  
18. Juli 2003 (18.07.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
02016066.9 19. Juli 2002 (19.07.2002) EP

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): GBF-GESELLSCHAFT FÜR BIOTECHNOLOGISCHE FORSCHUNG MBH [DE/DE]; Mascheroder  
Weg 1, 38124 Braunschweig (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MÜHLRADT, Peter  
[DE/DE]; Schuberstrasse 5, 38114 Braunschweig (DE).  
MORR, Michael [DE/DE]; Elmblick 53, 38302 Wolfen-  
büttel (DE).

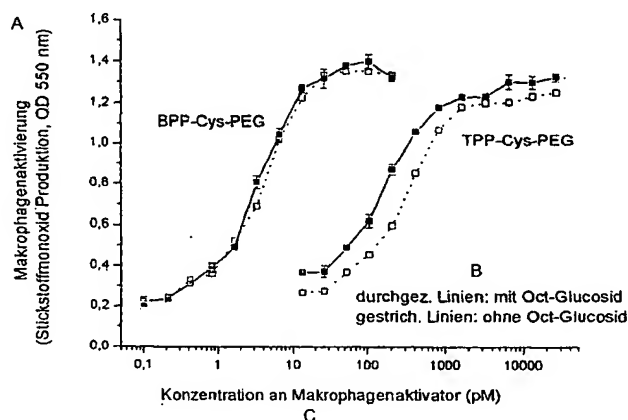
(74) Anwalt: LAÜFER, Martina; Gramm, Lins & Partner  
GbR, Freundallee 13, 30173 Hannover (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: BISACYLOXYPROPYLCYSTEINE CONJUGATES AND THE USE THEREOF

(54) Bezeichnung: BISACYLOXYPROPYLCYSTEIN-KONJUGATE UND DEREN VERWENDUNG



A MACROPHAGE ACTIVATION  
(NITROGEN MONOXIDE PRODUCTION, OD 550 NM)  
B SOLID LINES: WITH OCT-GLUCOSIDE  
DOTTED LINES: WITHOUT OCT-GLUCOSIDE  
C CONCENTRATION OF MACROPHAGE ACTIVATOR (PM)

(57) **Abstract:** The invention relates to novel lipopeptide conjugates, in which a cysteine that is double-substituted by a fatty acid is bonded by means of the carboxyl group to a highly soluble, physiologically compatible and non-immunogenic, polymeric conjugate group. The novel conjugates exhibit an excellent macrophage stimulant action and do not require additional solutizing. They can be used in a wide range of applications, in particular for stimulating macrophages, for stimulating antibody synthesis, for combating infection, as an immunostimulant, in particular in relation to tumours, for preventing and treating septicaemic shock, for wound healing and as an adjuvant for vaccines.

(57) **Zusammenfassung:** Es werden neue Lipopeptid-Konjugate vorgeschlagen, bei denen ein doppelt fettsäuresubstituiertes Cystein über die Carboxylgruppe an einen gut wasserlöslichen und physiologisch verträglichen sowie nicht immunogenen polymeren Konjugatrest gebunden ist. Die neuen Konjugate zeigen sehr gute makrophagenstimulierende Wirkung und benötigen keine zusätzliche Lösungsvermittlung. Sie bieten

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

WO 2004/009125 A2



RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR,  
TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

- (84) **Bestimmungsstaaten (regional):** ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Erklärungen gemäß Regel 4.17:**

- *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ,*

*NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)*

- *Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US*

**Veröffentlicht:**

- *ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts*

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*